

(19)



Europäisches Patentamt

European Patent Office

Office européen des brevets



(11)

EP 1 174 118 A1

(12)

EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

(43) Veröffentlichungstag:
23.01.2002 Patentblatt 2002/04

(51) Int Cl.7: **A61K 7/48**

(21) Anmeldenummer: 00440192.3

(22) Anmeldetag: 28.06.2000

(84) Benannte Vertragsstaaten:

AT BE CH CY DE DK ES FI FR GB GR IE IT LI LU
MC NL PT SE

Benannte Erstreckungsstaaten:

AL LT LV MK RO SI

(71) Anmelder: Cognis France S.A.
31360 Saint-Martory (FR)

(72) Erfinder:

- Danoux, Louis
54420 Saulxures-les-Nancy (FR)
- Rathjens, Andreas
40589 Düsseldorf (DE)

(74) Vertreter: Nuss, Pierre et al
10, rue Jacques Kablé
67080 Strasbourg Cédex (FR)

(54) **Verwendung von Inulinen und Inulinderivaten**

(57) Die Erfindung betrifft die Verwendung von Inu-

linen und/oder Inulinderivaten zur Herstellung von Haut-
pflegemitteln.

EP 1 174 118 A1

Beschreibung

Gebiet der Erfindung

- 5 **[0001]** Die Erfindung befindet sich auf dem Gebiet der Hautkosmetik und betrifft die Verwendung von Inulinen bzw. Inulinderivaten für eine Vielzahl von Anwendungen in der Behandlung und Pflege der menschlichen Haut.

Stand der Technik

- 10 **[0002]** An moderne Hautbehandlungsmittel werden vom Verbraucher heute hohe Anforderungen gestellt, wobei der pflegende und präventive Charakter immer stärker in den Vordergrund rückt. So sollen die Zubereitungen beispielsweise gleichzeitig sowohl vor Austrocknen, Alterung und Faltenbildung schützen, die Immunabwehr stärken, als auch Läsuren bekämpfen - also anti-inflammatorisch wirksam sein - und der Haut ein angenehmes sensorisches Gefühl vermitteln. Für die Herstellung solcher Produkte besteht daher das Problem, ihren Zubereitungen eine Vielzahl von
- 15 Wirkstoffen zuzusetzen, die gemeinsam das gewünschte Anforderungsprofil ergeben, ohne sich dabei gegenseitig zu stören oder gar unerwünschte Nebeneffekte zu erzeugen. Dem entsprechend besteht ein besonderes Interesse an Wirkstoffen, die die gewünschten Eigenschaften in sich vereinigen, zumal an solchen, die pflanzlicher Herkunft sind.
- [0003]** Die Aufgabe der vorliegenden Erfindung hat daher darin bestanden, solche Stoffe zur Verfügung zu stellen.

20 Beschreibung der Erfindung

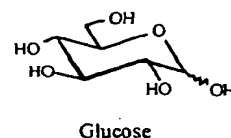
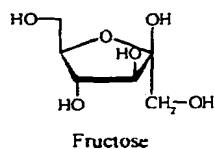
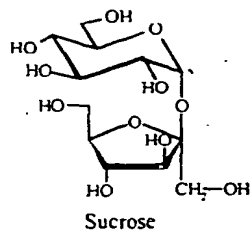
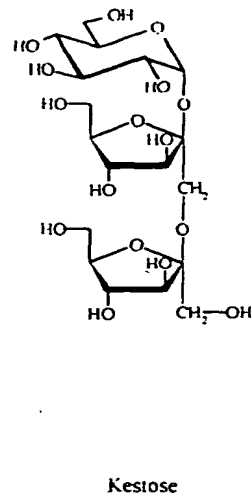
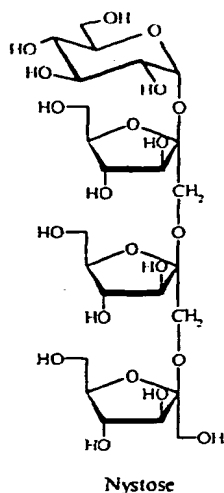
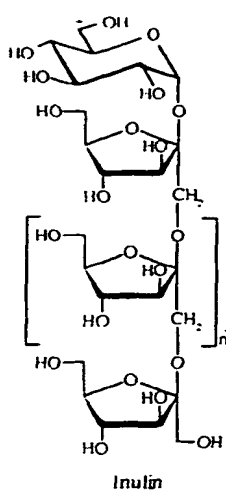
- [0004]** Gegenstand der Erfindung ist die Verwendung von Inulinen und/oder Inulinderivaten

- 25
- zur Herstellung von Hautpflegemitteln, insbesondere zur Pflege von trockener Haut,
 - zur Herstellung von Sonnenschutzmitteln, speziell solchen, die vor der UV-induzierten Hautalterung schützen,
 - zur Inhibierung der Melaninsynthese und damit zur Herstellung von Hautweißungsmitteln sowie
 - als anti-inflammatorische Wirkstoffe, speziell für empfindliche Haut und solche, die durch Akne in Mitleiden-
- schaft gezogen worden ist.
- 30 **[0005]** Überraschenderweise wurde gefunden, dass Inuline und deren Derivate, speziell Alkoxylierungs- und/oder Alkylierungsprodukte, über eine Vielzahl sowohl von kosmetischen als auch pharmazeutischen Wirkungen verfügen, die sie für den Einsatz in der Hautkosmetik besonders geeignet erscheinen lassen. Weitere Gegenstände der Erfindung betreffen die Verwendung von Inulinen und/oder Inulinderivaten
- 35
- zur Herstellung einer Zubereitung zur Stimulierung der Erneuerung von Hautzellen und dermalen Makromolekülen,
 - zur Herstellung einer Zubereitung zur Stimulation des Metabolismus und der Immunabwehr der menschlichen Haut, speziell zur Abwehr von oxidativem Streß, zur Stimulation der Synthese von Fettstoffen für das stratum corneum und damit zum Schutz der Haut vor Austrocknen,
- 40
- zur Herstellung einer Zubereitung zur Verminderung der Proteolyse und Glycation von Makromolekülen, wie z.B. Kollagen, Elastin, Proteoglycan in der menschlichen Haut durch Elastase-Inhibierung,
 - zur Herstellung einer Zubereitung zur Wundheilung sowie
 - zur Herstellung eines Medikamentes gegen Akne.

45 Inuline und Inulinderivate

- [0006]** Wie Stärke zählen auch die Inuline, wie z.B. Inulin, Nystose oder Kestose, zu den pflanzlichen Speicherstoffen, die von über 30.000 Pflanzen, vorzugsweise von Zichorien und Dahlien in größeren Mengen gebildet werden. Strukturell handelt es sich um ein Gemisch linearer Fructosepolymere (Oligofructoside), die über terminale Glucose-
- 50 gruppen verfügen und einen mittleren Oligomerisierungsgrad im Bereich von 5 bis 30, vorzugsweise um 15 aufweisen (siehe folgende Abbildung):

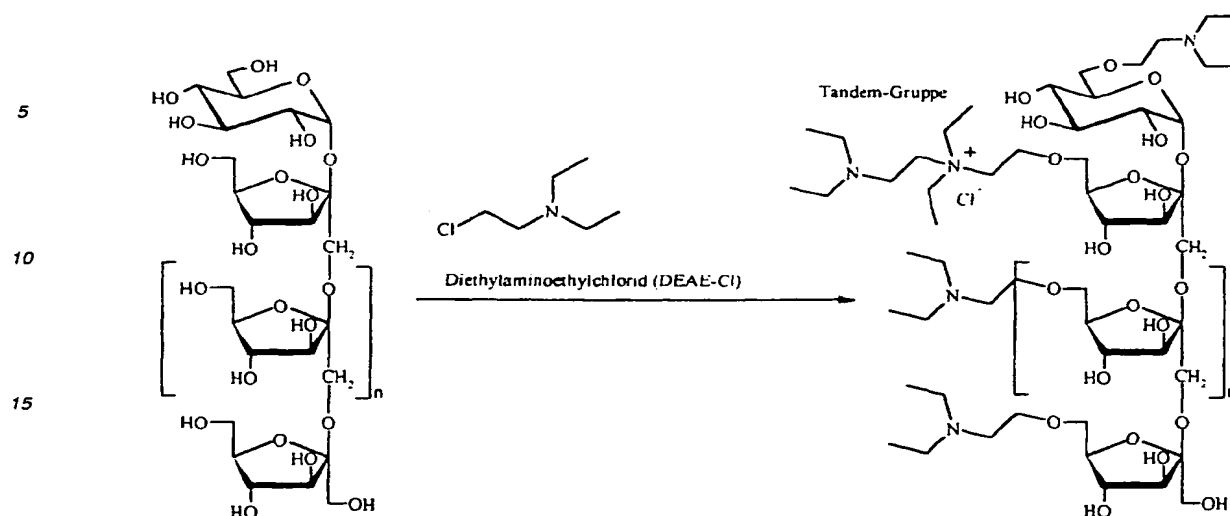
55



[0007] Herstellungsbedingt können im Handel befindliche Produkte, wie beispielsweise Frutafit® (Cosun) oder Rafitiline® (Orafti) neben höheren Oligomeren auch Glucose, Fructose oder Saccharose enthalten. Die Anwendung der Inuline liegt im wesentlichen im Bereich der Nahrungsmitteladditive, beispielsweise als Süßstoffe oder Prebiotics für Milchprodukte.

[0008] Die Alkoxylierung der Inuline kann in an sich bekannter Weise erfolgen, d.h. die Inuline werden in Gegenwart von alkalischen Katalysatoren, wie beispielsweise Natrium- oder Kaliumhydroxid, Natriummethylat oder Kalium-tert. butylat bei Temperaturen im Bereich von 50 bis 150 °C mit Ethylenoxid, Propylenoxid oder deren Gemischen - in Random- oder Blockverteilung - umgesetzt, wobei sich autogene Drücke von in der Regel 1 bis 5 bar einstellen. Nach Beendigung des Druckabfalls werden die Reaktionsprodukte entspannt und durch Zugabe von Mineralsäuren auf einen neutralen pH-Wert eingestellt. Die Einsatzmenge an Alkylenoxid ist an sich wenig kritisch, allerdings sollten so viele Alkylenoxidgruppen angelagert werden, daß dem Oligomer auch eine hinreichende Oberflächenaktivität verliehen wird. Demzufolge können bezogen auf Inulin 1 bis 100 und vorzugsweise 25 bis 75 Äquivalente Alkylenoxid zugegeben werden.

[0009] Zur Alkylierung der Inuline eignen sich insbesondere klassische Alkylierungsmittel, wie beispielsweise halogenierte Hydroxypropylammonium- oder 1,2-Epoxypropylammoniumsalze, die unter der Bezeichnung "QUAB" im Handel erhältlich sind. Ebenfalls geeignet ist auch Glycidol. Eine weitere interessante Möglichkeit Inuline in Derivate mit aktiven Eigenschaften zu überführen, besteht in der Umsetzung mit halogenierten Trialkylaminen, speziell Diethylaminoethylhalogeniden wie dem Diethylaminoethylchlorid (DEAE-Cl). Das Reaktionsschema ist in der nachfolgenden Abbildung wiedergegeben.



[0010] Neben einfachen DEAE-Funktionalitäten lassen sich auch sogenannte Tandem-Gruppen identifizieren, die durch N-Alkylierung einer schon am Inulingerüst gebundenen DEAE-Gruppe entstehen. Auf diese Weise werden potentiell kationische Zentren aufgebaut, welche bei der Wechselwirkung mit negativ geladenen Oberflächen, wie z.B. Haut und Haaren eine bedeutende Rolle spielen. Üblicherweise erfolgt die Herstellung dieser Derivate durch basische Alkylierung, beispielsweise in Wasser, organischen Lösungsmitteln (z.B. Isopropylalkohol) oder wäßrige/alkoholischen Gemischen. Bezogen auf die Inuline können 0,1 bis 10, vorzugsweise 0,5 bis 5 Äquivalente (Eq) des Alkylierungsmittels eingesetzt werden. Die Wahl der Base ist wenig kritisch, es empfiehlt sich beispielsweise mit 0,5 bis 1 M Natrium- oder Kaliumhydroxidlösung zu arbeiten. Die Alkylierung kann bei Temperaturen im Bereich von 0 bis 150 °C durchgeführt werden, ein Temperaturbereich von 20 bis 100 und insbesondere 50 bis 90 °C hat sich indes als besonders vorteilhaft erwiesen. Nach Abschluß der Reaktion werden die resultierenden wäßrigen und/oder organischen Lösungen vorteilhafterweise durch Zugabe von Mineralsäuren neutralisiert und beispielsweise durch Ultra- oder Diafiltration, Umkehrosmose oder vergleichbare Verfahren entsalzt. Die meist farblosen oder schwach gefärbten Produkte werden in der Regel anschließend vom Lösungsmittel befreit und getrocknet. Hierzu eignet sich insbesondere die Lyophilisierung.

[0011] Üblicherweise werden die Inuline bzw. Inulinderivate in Mengen von 0,0001 bis 5, vorzugsweise 0,001 bis 3 und insbesondere 0,01 bis 1 Gew.-% - bezogen auf die Endformulierungen - eingesetzt.

Kosmetische und/oder pharmazeutische Zubereitungen

[0012] Die erfindungsgemäß zu verwendenden Inuline und/oder Inulinderivate können zur Herstellung von kosmetischen und/oder pharmazeutischen Zubereitungen in Form von Cremes, Gele, Lotionen, alkoholische und wäßrig/alkoholische Lösungen, Emulsionen, Wachs/ Fett-Massen, Stiftpräparaten, Pudern oder Salben dienen. Diese Mittel können ferner als weitere Hilfs- und Zusatzstoffe milde Tenside, Ölkörper, Emulgatoren, Perlglanzwachse, Konsistenzgeber, Verdickungsmittel, Überfettungsmittel, Stabilisatoren, Polymere, Siliconverbindungen, Fette, Wachse, Lecithine, Phospholipide, biogene Wirkstoffe, UV-Lichtschutzfaktoren, Antioxidantien, Deodorantien, Antitranspirantien, Antischuppenmittel, Filmbildner, Quellmittel, Insektenrepellentien, Selbstbräuner, Tyrosininhibitoren (Depigmentierungsmittel), Hydrotrope, Solubilisatoren, Konservierungsmittel, Parfümöle, Farbstoffe und dergleichen enthalten.

Tenside

[0013] Als oberflächenaktive Stoffe können anionische, nichtionische, kationische und/oder amphotere bzw. amphotere Tenside enthalten sein, deren Anteil an den Mitteln üblicherweise bei etwa 1 bis 70, vorzugsweise 5 bis 50 und insbesondere 10 bis 30 Gew.-% beträgt. Typische Beispiele für anionische Tenside sind Seifen, Alkylbenzolsulfonate, Alkansulfonate, Olefinsulfonate, Alkylethersulfonate, Glycerinethersulfonate, α -Methylestersulfonate, Sulfatfettsäuren, Alkylsulfate, Fettalkoholethersulfate, Glycerinethersulfate, Fettsäureethersulfate, Hydroxymischethersulfate, Monoglycerid(ether)sulfate, Fettsäureamid(ether)sulfate, Mono- und Dialkylsulfosuccinate, Mono- und Dialkylsulfosuccinamate, Sulfotriglyceride, Amidseifen, Ethercarbonsäuren und deren Salze, Fettsäureisethionate, Fettsäuresarcosinate, Fettsäuretauride, N-Acylaminosäuren, wie beispielsweise Acyllactylate, Acyltartrate, Acylglutamate und Acylaspartate, Alkyloligoglucosidsulfate, Proteinfettsäurekondensate (insbesondere pflanzliche Produkte auf Weizenbasis) und Alkyl

(ether)phosphate. Sofern die anionischen Tenside Polyglycoetherketten enthalten, können diese eine konventionelle, vorzugsweise jedoch eine eingeeengte Homologenverteilung aufweisen. Typische Beispiele für nichtionische Tenside sind Fettalkoholpolyglycoether, Alkylphenolpolyglycoether, Fettsäurepolyglycolester, Fettsäureamidpolyglycoether, Fettaminpolyglycoether, alkoxylierte Triglyceride, Mischether bzw. Mischformale, gegebenenfalls partiell oxidierte Alk(en)yloligoglykoside bzw. Glucuronsäurederivate, Fettsäure-N-alkylglucamide, Proteinhydrolysate (insbesondere pflanzliche Produkte auf Weizenbasis), Polyolfettsäureester, Zuckerester, Sorbitanester, Polysorbate und Aminoxide. Sofern die nichtionischen Tenside Polyglycoetherketten enthalten, können diese eine konventionelle, vorzugsweise jedoch eine eingeeengte Homologenverteilung aufweisen. Typische Beispiele für kationische Tenside sind quartäre Ammoniumverbindungen, wie beispielsweise das Dimethyldistearylammoniumchlorid, und Esterquats, insbesondere quaternierte Fettsäuretrialkanolaminestersalze. Typische Beispiele für amphotere bzw. zwitterionische Tenside sind Alkylbetaine, Alkylamidobetaine, Aminopropionate, Aminoglycinate, Imidazoliniumbetaine und Sulfobetaine. Bei den genannten Tensiden handelt es sich ausschließlich um bekannte Verbindungen. Hinsichtlich Struktur und Herstellung dieser Stoffe sei auf einschlägige Übersichtsarbeiten beispielsweise J. Falbe (ed.), "Surfactants in Consumer Products", Springer Verlag, Berlin, 1987, S. 54-124 oder J. Falbe (ed.), "Katalysatoren, Tenside und Mineralöladitive", Thieme Verlag, Stuttgart, 1978, S. 123-217 verwiesen. Typische Beispiele für besonders geeignete milde, d.h. besonders hautverträgliche Tenside sind Fettalkoholpolyglycoethersulfate, Monoglyceridsulfate, Mono- und/oder Dialkylsulfosuccinate, Fettsäureisethionate, Fettsäuresarcosinate, Fettsäuretauride, Fettsäureglutamate, α -Olefinulfonate, Ethercarbon-säuren, Alkyloligoglucoside, Fettsäureglucamide, Alkylamidobetaine, Amphoacetale und/oder Proteinfettsäurekon-densate, letztere vorzugsweise auf Basis von Weizenproteinen.

Ölkörper

[0014] Als Ölkörper kommen beispielsweise Guerbetalkohole auf Basis von Fettalkoholen mit 6 bis 18, vorzugsweise 8 bis 10 Kohlenstoffatomen, Ester von linearen C_6 - C_{22} -Fettsäuren mit linearen oder verzweigten C_6 - C_{22} -Fettalkoholen bzw. Ester von verzweigten C_6 - C_{13} -Carbonsäuren mit linearen oder verzweigten C_6 - C_{22} -Fettalkoholen, wie z.B. Myristylmyristat, Myristylpalmitat, Myristylstearat, Myristylisostearat, Myristyloleat, Myristylbehenat, Myristylrucat, Cetylmyristat, Cetylpalmitat, Cetylstearat, Cetylisostearat, Cetyloleat, Cetylbehenat, Cetylerucat, Stearylmyristat, Stearylpalmitat, Stearylstearat, Stearylisostearat, Stearyloleat, Stearylbehenat, Stearylerucat, Isostearylmyristat, Isostearylpalmitat, Isostearylstearat, Isostearylisostearat, Isostearyloleat, Isostearylbehenat, Isostearyloleat, Oleylmyristat, Oleylpalmitat, Oleylstearat, Oleylisostearat, Oleyloleat, Oleylbehenat, Oleylerucat, Behenylmyristat, Behenylpalmitat, Behenylstearat, Behenylisostearat, Behenyloleat, Behenylbehenat, Behenylrucat, Erucylmyristat, Erucylpalmitat, Erucylstearat, Erucylisostearat, Erucyloleat, Erucylbehenat und Erucylrucat. Daneben eignen sich Ester von linearen C_6 - C_{22} -Fettsäuren mit verzweigten Alkoholen, insbesondere 2-Ethylhexanol, Ester von C_{18} - C_{38} -Alkylhydroxycarbon-säuren mit linearen oder verzweigten C_6 - C_{22} -Fettalkoholen (vgl. DE 19756377 A1), insbesondere Dioctyl Malate, Ester von linearen und/oder verzweigten Fettsäuren mit mehrwertigen Alkoholen (wie z.B. Propylenglycol, Dimerdiol oder Trimertriol) und/oder Guerbetalkoholen, Triglyceride auf Basis C_6 - C_{10} -Fettsäuren, flüssige Mono-/Di-/Triglyceridmischungen auf Basis von C_6 - C_{18} -Fettsäuren, Ester von C_6 - C_{22} -Fettalkoholen und/oder Guerbetalkoholen mit aromatischen Carbonsäuren, insbesondere Benzoesäure, Ester von C_2 - C_{12} -Dicarbonsäuren mit linearen oder verzweigten Alkoholen mit 1 bis 22 Kohlenstoffatomen oder Polyolen mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen und 2 bis 6 Hydroxylgruppen, pflanzliche Öle, verzweigte primäre Alkohole, substituierte Cyclohexane, lineare und verzweigte C_6 - C_{22} -Fettalkohol-carbonate, wie z.B. Dicaprylyl Carbonate (Cetio® CC), Guerbetcarbonate auf Basis von Fettalkoholen mit 6 bis 18, vorzugsweise 8 bis 10 C Atomen, Ester der Benzoesäure mit linearen und/oder verzweigten C_6 - C_{22} -Alkoholen (z.B. Finsolv® TN), lineare oder verzweigte, symmetrische oder unsymmetrische Dialkylether mit 6 bis 22 Kohlenstoffatomen pro Alkylgruppe, wie z.B. Dicaprylyl Ether (Cetio® OE), Ringöffnungsprodukte von epoxidierten Fettsäureestern mit Polyolen, Siliconöle (Cyclomethicone, Siliciummethicontypen u.a.) und/oder aliphatische bzw. naphthenische Kohlen-wasserstoffe, wie z.B. wie Squalan, Squalen oder Dialkylcyclohexane in Betracht.

Emulgatoren

[0015] Als Emulgatoren kommen beispielsweise nichtionogene Tenside aus mindestens einer der folgenden Grup-pen in Frage:

- > Anlagerungsprodukte von 2 bis 30 Mol Ethylenoxid und/ oder 0 bis 5 Mol Propylenoxid an lineare Fettalkohole mit 8 bis 22 C-Atomen, an Fettsäuren mit 12 bis 22 C-Atomen, an Alkylphenole mit 8 bis 15 C-Atomen in der Alkylgruppe sowie Alkylamine mit 8 bis 22 Kohlenstoffatomen im Alkylrest;
- > Alkyl- und/oder Alkenyloligoglykoside mit 8 bis 22 Kohlenstoffatomen im Alk(en)ylrest und deren ethoxylierte Analoga;
- > Anlagerungsprodukte von 1 bis 15 Mol Ethylenoxid an Ricinusöl und/oder gehärtetes Ricinusöl;

- Anlagerungsprodukte von 15 bis 60 Mol Ethylenoxid an Ricinusöl und/oder gehärtetes Ricinusöl;
- Partialester von Glycerin und/oder Sorbitan mit ungesättigten, linearen oder gesättigten, verzweigten Fettsäuren mit 12 bis 22 Kohlenstoffatomen und/oder Hydroxycarbonsäuren mit 3 bis 18 Kohlenstoffatomen sowie deren Addukte mit 1 bis 30 Mol Ethylenoxid;
- Partialester von Polyglycerin (durchschnittlicher Eigenkondensationsgrad 2 bis 8), Polyethylenglycol (Molekulargewicht 400 bis 5000), Trimethylolpropan, Pentaerythrit, Zuckerkohlen (z.B. Sorbit), Alkylglucosiden (z.B. Methylglucosid, Butylglucosid, Laurylglucosid) sowie Polyglucosiden (z.B. Cellulose) mit gesättigten und/oder ungesättigten, linearen oder verzweigten Fettsäuren mit 12 bis 22 Kohlenstoffatomen und/oder Hydroxycarbonsäuren mit 3 bis 18 Kohlenstoffatomen sowie deren Addukte mit 1 bis 30 Mol Ethylenoxid;
- Mischester aus Pentaerythrit, Fettsäuren, Citronensäure und Fettalkohol gemäß DE 1165574 PS und/oder Mischester von Fettsäuren mit 6 bis 22 Kohlenstoffatomen, Methylglucose und Polyolen, vorzugsweise Glycerin oder Polyglycerin.
- Mono-, Di- und Trialkylphosphate sowie Mono-, Di- und/oder Tri-PEG-alkylphosphate und deren Salze;
- Wollwachsalkohole;
- Polysiloxan-Polyalkyl-Polyether-Copolymere bzw. entsprechende Derivate;
- Block-Copolymere z.B. Polyethylenglycol-30 Dipolyhydroxystearate;
- Polymeremulgatoren, z.B. Pemulen-Typen (TR-1, TR-2) von Goodrich;
- Polyalkylenglycole sowie
- Glycerincarbonat.

[0016] Die Anlagerungsprodukte von Ethylenoxid und/oder von Propylenoxid an Fettalkohole, Fettsäuren, Alkylphenole oder an Ricinusöl stellen bekannte, im Handel erhältliche Produkte dar. Es handelt sich dabei um Homologengemische, deren mittlerer Alkoxyierungsgrad dem Verhältnis der Stoffmengen von Ethylenoxid und/oder Propylenoxid und Substrat, mit denen die Anlagerungsreaktion durchgeführt wird, entspricht. C_{12/18}-Fettsäuremono- und -diester von Anlagerungsprodukten von Ethylenoxid an Glycerin sind aus DE 2024051 PS als Rückfettungsmittel für kosmetische Zubereitungen bekannt.

[0017] Alkyl- und/oder Alkenyloligoglycoside, ihre Herstellung und ihre Verwendung sind aus dem Stand der Technik bekannt. Ihre Herstellung erfolgt insbesondere durch Umsetzung von Glucose oder Oligosacchariden mit primären Alkoholen mit 8 bis 18 Kohlenstoffatomen. Bezüglich des Glycosidrestes gilt, daß sowohl Monoglycoside, bei denen ein cyclischer Zuckerrest glycosidisch an den Fettalkohol gebunden ist, als auch oligomere Glycoside mit einem Oligomerisationsgrad bis vorzugsweise etwa 8 geeignet sind. Der Oligomerisierungsgrad ist dabei ein statistischer Mittelwert, dem eine für solche technischen Produkte übliche Homologenverteilung zugrunde liegt.

[0018] Typische Beispiele für geeignete Partialglyceride sind Hydroxystearinsäuremonoglycerid, Hydroxystearinsäurediglycerid, Isostearinsäuremonoglycerid, Isostearinsäurediglycerid, Ölsäuremonoglycerid, Ölsäurediglycerid, Ricinolsäuremonoglycerid, Ricinolsäurediglycerid, Linolsäuremonoglycerid, Linolsäurediglycerid, Linolensäuremonoglycerid, Linolensäurediglycerid, Erucasäuremonoglycerid, Erucasäurediglycerid, Weinsäuremonoglycerid, Weinsäurediglycerid, Citronensäuremonoglycerid, Citronendiglycerid, Äpfelsäuremonoglycerid, Äpfelsäurediglycerid sowie deren technische Gemische, die untergeordnet aus dem Herstellungsprozeß noch geringe Mengen an Triglycerid enthalten können. Ebenfalls geeignet sind Anlagerungsprodukte von 1 bis 30, vorzugsweise 5 bis 10 Mol Ethylenoxid an die genannten Partialglyceride.

[0019] Als Sorbitanester kommen Sorbitanmonoistearat, Sorbitansesquiistearat, Sorbitandiistearat, Sorbitantriistearat, Sorbitanmonooleat, Sorbitansesquioleat, Sorbitandioleat, Sorbitantrioleat, Sorbitanmonoerucat, Sorbitansesquierucat, Sorbitandierucat, Sorbitantrierucat, Sorbitanmonoricinoleat, Sorbitansesquiricinoleat, Sorbitandiricinoleat, Sorbitantriricinoleat, Sorbitanmonohydroxystearat, Sorbitansesquihydroxystearat, Sorbitandihydroxystearat, Sorbitantrihydroxystearat, Sorbitanmonotartrat, Sorbitansesquitartrat, Sorbitanditartrat, Sorbitantritartrat, Sorbitanmonocitrat, Sorbitansesquicitrat, Sorbitandicitrat, Sorbitantricitrat, Sorbitanmonomaleat, Sorbitansesquimaleat, Sorbitandimaleat, Sorbitantrimaleat sowie deren technische Gemische. Ebenfalls geeignet sind Anlagerungsprodukte von 1 bis 30, vorzugsweise 5 bis 10 Mol Ethylenoxid an die genannten Sorbitanester.

[0020] Typische Beispiele für geeignete Polyglycerinester sind Polyglyceryl-2 Dipolyhydroxystearate (Dehymuls® PGPH), Polyglycerin-3-Diistearate (Lameform® TGI), Polyglyceryl-4 Isostearate (Isolan® GI 34), Polyglyceryl-3 Oleate, Diistearoyl Polyglyceryl-3 Diistearate (Isolan® PDI), Polyglyceryl-3 Methylglucose Distearate (Tego Care® 450), Polyglyceryl-3 Beeswax (Cera Bellina®), Polyglyceryl-4 Caprate (Polyglycerol Caprate T2010/90), Polyglyceryl-3 Cetyl Ether (Chimexane® NL), Polyglyceryl-3 Distearate (Cremophor® GS 32) und Polyglyceryl Polyricinoleate (Admuk® WOL 1403) Polyglyceryl Dimerate Isostearate sowie deren Gemische. Beispiele für weitere geeignete Polyolester sind die gegebenenfalls mit 1 bis 30 Mol Ethylenoxid umgesetzten Mono-, Di- und Triester von Trimethylolpropan oder Pentaerythrit mit Laurinsäure, Kokosfettsäure, Talgfettsäure, Palmitinsäure, Stearinsäure, Ölsäure, Behensäure und dergleichen.

[0021] Weiterhin können als Emulgatoren zwitterionische Tenside verwendet werden. Als zwitterionische Tenside

werden solche oberflächenaktiven Verbindungen bezeichnet, die im Molekül mindestens eine quartäre Ammoniumgruppe und mindestens eine Carboxylat- und eine Sulfonatgruppe tragen. Besonders geeignete zwitterionische Tenside sind die sogenannten Betaine wie die N-Alkyl-N,N-dimethylammoniumglycinate, beispielsweise das Kokosalkyldimethylammoniumglycinat, N-Acylaminopropyl-N,N-dimethylammoniumglycinate, beispielsweise das Kokosacylaminopropyltrimethylammoniumglycinat, und 2-Alkyl-3-carboxymethyl-3-hydroxyethylimidazoline mit jeweils 8 bis 18 C-Atomen in der Alkyl- oder Acylgruppe sowie das Kokosacylaminoethylhydroxyethylcarboxymethylglycinat. Besonders bevorzugt ist das unter der CTFA-Bezeichnung *Cocamidopropyl Betaine* bekannte Fettsäureamid-Derivat. Ebenfalls geeignete Emulgatoren sind ampholytische Tenside. Unter ampholytischen Tensiden werden solche oberflächenaktiven Verbindungen verstanden, die außer einer C_{8/18}-Alkyl- oder -Acylgruppe im Molekül mindestens eine freie Aminogruppe und mindestens eine -COOH- oder -SO₃H-Gruppe enthalten und zur Ausbildung innerer Salze befähigt sind. Beispiele für geeignete ampholytische Tenside sind N-Alkylglycine, N-Alkylpropionsäuren, N-Alkylaminobuttersäuren, N-Alkyliminodipropionsäuren, N-Hydroxyethyl-N-alkylamidopropylglycine, N-Alkyltaurine, N-Alkylsarcosine, 2-Alkylaminopropionsäuren und Alkylaminoessigsäuren mit jeweils etwa 8 bis 18 C-Atomen in der Alkylgruppe. Besonders bevorzugte ampholytische Tenside sind das N-Kokosalkylaminopropionat, das Kokosacylaminoethylaminopropionat und das C_{12/16}-Acylsarcosin. Schließlich kommen auch Kationtenside als Emulgatoren in Betracht, wobei solche vom Typ der Esterquats, vorzugsweise methylquaternierte Difettsäuretriethanolaminester-Salze, besonders bevorzugt sind.

Fette und Wachse

[0022] Typische Beispiele für Fette sind Glyceride, d.h. feste oder flüssige pflanzliche oder tierische Produkte, die im wesentlichen aus gemischten Glycerinestern höherer Fettsäuren bestehen, als Wachse kommen u.a. natürliche Wachse, wie z.B. Candelillawachs, Carnaubawachs, Japanwachs, Espartograswachs, Korkwachs, Guarumawachs, Reiskeimölwachs, Zuckerrohrwachs, Ouricurywachs, Montanwachs, Bienenwachs, Schellackwachs, Walrat, Lanolin (Wollwachs), Bürzelfett, Ceresin, Ozokerit (Erdwachs), Petrolatum, Paraffinwachse, Mikrowachse; chemisch modifizierte Wachse (Hartwachse), wie z.B. Montanesterwachse, Sasolwachse, hydrierte Jojobawachse sowie synthetische Wachse, wie z.B. Polyalkylenwachse und Polyethylenglycolwachse in Frage. Neben den Fetten kommen als Zusatzstoffe auch fettähnliche Substanzen, wie Lecithine und Phospholipide in Frage. Unter der Bezeichnung Lecithine versteht der Fachmann diejenigen Glycero-Phospholipide, die sich aus Fettsäuren, Glycerin, Phosphorsäure und Cholin durch Veresterung bilden. Lecithine werden in der Fachwelt daher auch häufig als Phosphatidylcholine (PC). Als Beispiele für natürliche Lecithine seien die Kephale genannt, die auch als Phosphatidsäuren bezeichnet werden und Derivate der 1,2-Diacyl-sn-glycerin-3-phosphorsäuren darstellen. Dem gegenüber versteht man unter Phospholipiden gewöhnlich Mono- und vorzugsweise Diester der Phosphorsäure mit Glycerin (Glycerinphosphate), die allgemein zu den Fetten gerechnet werden. Daneben kommen auch Sphingosine bzw. Sphingolipide in Frage.

Perlglanzwachse

[0023] Als Perlglanzwachse kommen beispielsweise in Frage: Alkylenglycolester, speziell Ethylenglycoldistearat; Fettsäurealkanamide, speziell Kokosfettsäurediethanolamid; Partialglyceride, speziell Stearinsäuremonoglycerid; Ester von mehrwertigen, gegebenenfalls hydroxysubstituierte Carbonsäuren mit Fettalkoholen mit 6 bis 22 Kohlenstoffatomen, speziell langkettige Ester der Weinsäure; Fettstoffe, wie beispielsweise Fettalkohole, Fettketone, Fettaldehyde, Fettether und Fettcarbonate, die in Summe mindestens 24 Kohlenstoffatome aufweisen, speziell Lauron und Distearylether; Fettsäuren wie Stearinsäure, Hydroxystearinsäure oder Behensäure, Ringöffnungsprodukte von Olefinepoxiden mit 12 bis 22 Kohlenstoffatomen mit Fettalkoholen mit 12 bis 22 Kohlenstoffatomen und/oder Polyolen mit 2 bis 15 Kohlenstoffatomen und 2 bis 10 Hydroxylgruppen sowie deren Mischungen.

Konsistenzgener und Verdickungsmittel

[0024] Als Konsistenzgeber kommen in erster Linie Fettalkohole oder Hydroxyfettalkohole mit 12 bis 22 und vorzugsweise 16 bis 18 Kohlenstoffatomen und daneben Partialglyceride, Fettsäuren oder Hydroxyfettsäuren in Betracht. Bevorzugt ist eine Kombination dieser Stoffe mit Alkyloligoglucosiden und/oder Fettsäure-N-methylglucamiden gleicher Kettenlänge und/oder Polyglycerinpoly-12-hydroxystearaten. Geeignete Verdickungsmittel sind beispielsweise Aerosil-Typen (hydrophile Kieselsäuren), Polysaccharide, insbesondere Xanthan-Gum, Guar-Guar, Agar-Agar, Alginate und Tylosen, Carboxymethylcellulose und Hydroxyethylcellulose, ferner höhermolekulare Polyethylenglycolmono- und -diester von Fettsäuren, Polyacrylate, (z.B. Carbopole® und Pemulen-Typen von Goodrich; Synthalene® von Sigma; Keltrol-Typen von Kelco; Sepigel-Typen von Seppic; Salcare-Typen von Allied Colloids), Polyacrylamide, Polymere, Polyvinylalkohol und Polyvinylpyrrolidon, Tenside wie beispielsweise ethoxylierte Fettsäureglyceride, Ester von Fettsäuren mit Polyolen wie beispielsweise Pentaerythrit oder Trimethylolpropan, Fettalkoholethoxylylate mit eingengter

Homologenverteilung oder Alkyloligoglucoside sowie Elektrolyte wie Kochsalz und Ammoniumchlorid.

Überfettungsmittel

[0025] Als Überfettungsmittel können Substanzen wie beispielsweise Lanolin und Lecithin sowie polyethoxylierte oder acylierte Lanolin- und Lecithinderivate, Polyolfettsäureester, Monoglyceride und Fettsäurealkanolamide verwendet werden, wobei die letzteren gleichzeitig als Schaumstabilisatoren dienen.

Stabilisatoren

[0026] Als Stabilisatoren können Metallsalze von Fettsäuren, wie z.B. Magnesium-, Aluminium- und/oder Zinkstearat bzw. -ricinoleat eingesetzt werden.

Polymere

[0027] Geeignete kationische Polymere sind beispielsweise kationische Cellulosederivate, wie z.B. eine quaternierte Hydroxyethylcellulose, die unter der Bezeichnung Polymer JR 400® von Amerchol erhältlich ist, kationische Stärke, Copolymere von Diallylammoniumsalzen und Acrylamiden, quaternierte Vinylpyrrolidon/Vinylimidazol-Polymere, wie z.B. Luviquat® (BASF), Kondensationsprodukte von Polyglycolen und Aminen, quaternierte Kollagenpolypeptide, wie beispielsweise Lauryldimonium Hydroxypropyl Hydrolyzed Collagen (Lamequat®/Grünau), quaternierte Weizenpolypeptide, Polyethylenimin, kationische Siliconpolymere, wie z.B. Amodimethicone, Copolymere der Adipinsäure und Dimethylaminohydroxypropyldiethylentriamin (Cartaretine®/Sandoz), Copolymere der Acrylsäure mit Dimethyl-diallylammoniumchlorid (Merquat® 550/Chemviron), Polyaminopolyamide, wie z.B. beschrieben in der FR 2252840 A sowie deren vernetzte wasserlöslichen Polymere, kationische Chitinderivate wie beispielsweise quaterniertes Chitosan, gegebenenfalls mikrokristallin verteilt, Kondensationsprodukte aus Dihalogenkalkylen, wie z.B. Dibrombutan mit Bisdialkylaminen, wie z.B. Bis-Dimethylamino-1,3-propan, kationischer Guar-Gum, wie z.B. Jaguar® CBS, Jaguar® C-17, Jaguar® C-16 der Firma Celanese, quaternierte Ammoniumsalz-Polymere, wie z.B. Mirapol® A-15, Mirapol® AD-1, Mirapol® AZ-1 der Firma Miranol.

[0028] Als anionische, zwitterionische, amphotere und nichtionische Polymere kommen beispielsweise Vinylacetat/Crotonsäure-Copolymere, Vinylpyrrolidon/Vinylacrylat-Copolymere, Vinylacetat/Butylmaleat/Isobornylacrylat-Copolymere, Methylvinylether/Maleinsäureanhydrid-Copolymere und deren Ester, unvernetzte und mit Polyolen vernetzte Polyacrylsäuren, Acrylamidpropyltrimethylammoniumchlorid/ Acrylat-Copolymere, Octylacrylamid/Methylmethacrylat/tert. Butylaminoethylmethacrylat/2-Hydroxypropylmethacrylat-Copolymere, Polyvinylpyrrolidon, Vinylpyrrolidon/Vinylacetat-Copolymere, Vinylpyrrolidon/ Dimethylaminoethylmethacrylat/Vinylcaprolactam-Terpolymere sowie gegebenenfalls derivatisierte Celluloseether und Silicone in Frage. Weitere geeignete Polymere und Verdickungsmittel sind in Cosm.Toil. 108, 95 (1993) aufgeführt.

Siliconverbindungen

[0029] Geeignete Siliconverbindungen sind beispielsweise Dimethylpolysiloxane, Methylphenylpolysiloxane, cyclische Silicone sowie amino-, fettsäure-, alkohol-, polyether-, epoxy-, fluor-, glykosid- und/oder alkyloxy-modifizierte Siliconverbindungen, die bei Raumtemperatur sowohl flüssig als auch harzförmig vorliegen können. Weiterhin geeignet sind Dimethicone, bei denen es sich um Mischungen aus Dimethiconen mit einer durchschnittlichen Kettenlänge von 200 bis 300 Dimethylsiloxan-Einheiten und hydrierten Silicaten handelt. Eine detaillierte Übersicht über geeignete flüchtige Silicone findet sich zudem von Todd et al. in Cosm.Toil. 91, 27 (1976).

UV-Lichtschutzfilter und Antioxidantien

[0030] Unter UV-Lichtschutzfaktoren sind beispielsweise bei Raumtemperatur flüssig oder kristallin vorliegende organische Substanzen (Lichtschutzfilter) zu verstehen, die in der Lage sind, ultraviolette Strahlen zu absorbieren und die aufgenommene Energie in Form längerwelliger Strahlung, z.B. Wärme wieder abzugeben. UVB-Filter können öllöslich oder wasserlöslich sein. Als öllösliche Substanzen sind z.B. zu nennen:

- > 3-Benzylidencampher bzw. 3-Benzylidennorcampher und dessen Derivate, z.B. 3-(4-Methylbenzyliden)campher wie in der EP 0693471 B1 beschrieben;
- > 4-Aminobenzoesäurederivate, vorzugsweise 4-(Dimethylamino)benzoesäure-2-ethylhexylester, 4-(Dimethylamino)benzoesäure-2-octylester und 4-(Dimethylamino)benzoesäureamylester;
- > Ester der Zimtsäure, vorzugsweise 4-Methoxyzimtsäure-2-ethylhexylester, 4-Methoxyzimtsäurepropylester,

EP 1 174 118 A1

4-Methoxyzimtsäureisoamylester 2-Cyano-3,3-phenylzimtsäure-2-ethylhexylester (Octocrylene);

> Ester der Salicylsäure, vorzugsweise Salicylsäure-2-ethylhexylester, Salicylsäure-4-isopropylbenzylester, Salicylsäurehomomenthylester;

> Derivate des Benzophenons, vorzugsweise 2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon, 2-Hydroxy-4-methoxy-4'-methylbenzophenon, 2,2'-Dihydroxy-4-methoxybenzophenon;

> Ester der Benzalmalonsäure, vorzugsweise 4-Methoxybenzmalonsäuredi-2-ethylhexylester;

> Triazinderivate, wie z.B. 2,4,6-Triänilino-(p-carbo-2'-ethyl-1'-hexyloxy)-1,3,5-triazin und Octyl Triazon, wie in der EP 0818450 A1 beschrieben oder Diethyl Butamido Triazon (Uvasorb® HEB);

> Propan-1,3-dione, wie z.B. 1-(4-tert-Butylphenyl)-3-(4'-methoxyphenyl)propan-1,3-dion;

> Ketotricyclo(5.2.1.0)decan-Derivate, wie in der EP 0694521 B1 beschrieben.

[0031] Als wasserlösliche Substanzen kommen in Frage:

> 2-Phenylbenzimidazol-5-sulfonsäure und deren Alkali-, Erdalkali-, Ammonium-, Alkylammonium-, Alkanolammonium- und Glucammoniumsalze;

> Sulfonsäurederivate von Benzophenonen, vorzugsweise 2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon-5-sulfonsäure und ihre Salze;

> Sulfonsäurederivate des 3-Benzylidencamphers, wie z.B. 4-(2-Oxo-3-bornylidenmethyl)benzolsulfonsäure und 2-Methyl-5-(2-oxo-3-bornyliden)sulfonsäure und deren Salze.

[0032] Als typische UV-A-Filter kommen insbesondere Derivate des Benzoylmethans in Frage, wie beispielsweise 1-(4'-tert-Butylphenyl)-3-(4'-methoxyphenyl)propan-1,3-dion, 4-tert-Butyl-4'-methoxydibenzoylmethan (Parsol® 1789), 1-Phenyl-3-(4'-isopropylphenyl)-propan-1,3-dion sowie Enaminverbindungen, wie beschrieben in der DE 19712033 A1 (BASF). Die UV-A und UV-B-Filter können selbstverständlich auch in Mischungen eingesetzt werden. Besonders günstige Kombinationen bestehen aus den Derivate des Benzoylmethans" z.B. 4-tert-Butyl-4'-methoxydibenzoylmethan (Parsol® 1789) und 2-Cyano-3,3-phenylzimtsäure-2-ethylhexylester (Octocrylene) in Kombination mit Ester der Zimtsäure, vorzugsweise 4-Methoxyzimtsäure-2-ethylhexylester und/oder 4-Methoxyzimtsäurepropylester und/oder 4-Methoxyzimtsäureisoamylester. Vorteilhaft werden deartige Kombinationen mit wasserlöslichen Filtern wie z.B. 2-Phenylbenzimidazol-5-sulfonsäure und deren Alkali-, Erdalkali-, Ammonium-, Alkylammonium-, Alkanolammonium- und Glucammoniumsalze kombiniert.

[0033] Neben den genannten löslichen Stoffen kommen für diesen Zweck auch unlösliche Lichtschutzpigmente, nämlich feindisperse Metalloxide bzw. Salze in Frage. Beispiele für geeignete Metalloxide sind insbesondere Zinkoxid und Titandioxid und daneben Oxide des Eisens, Zirkoniums, Siliciums, Mangans, Aluminiums und Cers sowie deren Gemische. Als Salze können Silicate (Talk), Bariumsulfat oder Zinkstearat eingesetzt werden. Die Oxide und Salze werden in Form der Pigmente für hautpflegende und hautschützende Emulsionen und dekorative Kosmetik verwendet. Die Partikel sollten dabei einen mittleren Durchmesser von weniger als 100 nm, vorzugsweise zwischen 5 und 50 nm und insbesondere zwischen 15 und 30 nm aufweisen. Sie können eine sphärische Form aufweisen, es können jedoch auch solche Partikel zum Einsatz kommen, die eine ellipsoide oder in sonstiger Weise von der sphärischen Gestalt abweichende Form besitzen. Die Pigmente können auch oberflächenbehandelt, d.h. hydrophilisiert oder hydrophobiert vorliegen. Typische Beispiele sind gecoatete Titandioxide, wie z.B. Titandioxid T 805 (Degussa) oder Eusolex® T2000 (Merck). Als hydrophobe Coatingmittel kommen dabei vor allem Silicone und dabei speziell Trialkoxyoctylsilane oder Simethicone in Frage. In Sonnenschutzmitteln werden bevorzugt sogenannte Mikro- oder Nanopigmente eingesetzt. Vorzugsweise wird mikronisiertes Zinkoxid verwendet. Weitere geeignete UV-Lichtschutzfilter sind der Übersicht von P.Finkel in SÖFW-Journal 122, 543 (1996) sowie Parf.Kosm. 3, 11 (1999) zu entnehmen.

[0034] Neben den beiden vorgenannten Gruppen primärer Lichtschutzstoffe können auch sekundäre Lichtschutzmittel vom Typ der Antioxidantien eingesetzt werden, die die photochemische Reaktionskette unterbrechen, welche ausgelöst wird, wenn UV-Strahlung in die Haut eindringt. Typische Beispiele hierfür sind Aminosäuren (z.B. Glycin, Histidin, Tyrosin, Tryptophan) und deren Derivate, Imidazole (z.B. Urocaninsäure) und deren Derivate, Peptide wie D, L-Carnosin, D-Carnosin, L-Carnosin und deren Derivate (z.B. Anserin), Carotinoide, Carotine (z.B. α -Carotin, β -Carotin, Lycopin) und deren Derivate, Chlorogensäure und deren Derivate, Liponsäure und deren Derivate (z.B. Dihydroliponsäure), Aurothioglucose, Propylthiouracil und andere Thiole (z.B. Thioredoxin, Glutathion, Cystein, Cystin, Cystamin und deren Glycosyl-, N-Acetyl-, Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Amyl-, Butyl- und Lauryl-, Palmitoyl-, Oleyl-, γ -Linoleyl-, Cholesteryl- und Glycerylester) sowie deren Salze, Dilaurylthiodipropionat, Distearylthiodipropionat, Thiodipropionsäure und deren Derivate (Ester, Ether, Peptide, Lipide, Nukleotide, Nukleoside und Salze) sowie Sulfoximinverbindungen (z.B. Buthioninsulfoximine, Homocysteinsulfoximin, Butioninsulfone, Penta-, Hexa-, Heptathioninsulfoximin) in sehr geringen verträglichen Dosierungen (z.B. pmol bis μ mol/kg), ferner (Metall)-Chelatoren (z.B. α -Hydroxyfettsäuren, Palmitinsäure, Phytinsäure, Lactoferrin), α -Hydroxysäuren (z.B. Citronensäure, Milchsäure, Äpfelsäure), Huminsäure, Gallensäure, Gallenextrakte, Bilirubin, Biliverdin, EDTA, EGTA und deren Derivate, ungesättigte Fettsäuren und deren

Derivate (z.B. γ -Linolensäure, Linolsäure, Ölsäure), Folsäure und deren Derivate, Ubichinon und Ubichinol und deren Derivate, Vitamin C und Derivate (z.B. Ascorbylpalmitat, Mg-Ascorbylphosphat, Ascorbylacetat), Tocopherole und Derivate (z.B. Vitamin-E-acetat), Vitamin A und Derivate (Vitamin-A-palmitat) sowie Koniferylbenzoat des Benzoeharzes, Rutinsäure und deren Derivate, α -Glycosylrutin, Ferulasäure, Furfurylidenglucitol, Carnosin, Butylhydroxytoluol, Butylhydroxyanisol, Nordihydroguajakharzsäure, Nordihydroguajaretssäure, Trihydroxybutyrophenon, Harnsäure und deren Derivate, Mannose und deren Derivate, Superoxid-Dismutase, Zink und dessen Derivate (z.B. ZnO, ZnSO₄) Selen und dessen Derivate (z.B. Selen-Methionin), Stilbene und deren Derivate (z.B. Stilbenoxid, trans-Stilbenoxid) und die erfindungsgemäß geeigneten Derivate (Salze, Ester, Ether, Zucker, Nukleotide, Nukleoside, Peptide und Lipide) dieser genannten Wirkstoffe.

Biogene Wirkstoffe

[0035] Unter biogenen Wirkstoffen sind beispielsweise Tocopherol, Tocopherolacetat, Tocopherolpalmitat, Ascorbinsäure, (Desoxy)Ribonucleinsäure und deren Fragmentierungsprodukte, Retinol, Bisabolol, Allantoin, Phytantriol, Panthenol, AHA-Säuren, Aminosäuren, Ceramide, Pseudoceramide, essentielle Öle, Pflanzenextrakte und Vitaminkomplexe zu verstehen.

Deodorantien und keimhemmende Mittel

[0036] Kosmetische Deodorantien (Desodorantien) wirken Körpergerüchen entgegen, überdecken oder beseitigen sie. Körpergerüche entstehen durch die Einwirkung von Hautbakterien auf apokrinen Schweiß, wobei unangenehm riechende Abbauprodukte gebildet werden. Dementsprechend enthalten Deodorantien Wirkstoffe, die als keimhemmende Mittel, Enzyminhibitoren, Geruchsabsorber oder Geruchsüberdecker fungieren. Als keimhemmende Mittel sind grundsätzlich alle gegen grampositive Bakterien wirksamen Stoffe geeignet, wie z. B. 4-Hydroxybenzoesäure und ihre Salze und Ester, N-(4-Chlorphenyl)-N'-(3,4-dichlorphenyl)hamstoff, 2,4,4'-Trichlor-2'-hydroxydiphenylether (Triclosan), 4-Chlor-3,5-dimethylphenol, 2,2'-Methylen-bis(6-brom-4-chlorphenol), 3-Methyl-4-(1-methylethyl)-phenol, 2-Benzyl-4-chlorphenol, 3-(4-Chlorphenoxy)-1,2-propandiol, 3-Iod-2-propinylbutylcarbamate, Chlorhexidin, 3,4,4'-Trichlorcarbanilid (TTC), antibakterielle Riechstoffe, Thymol, Thymianöl, Eugenol, Nelkenöl, Menthol, Minzöl, Farnesol, Phenoxylethanol, Glycerinmonocaprylat, Glycerinmonolaurat (GML), Diglycerinmonocaprynat (DMC), Salicylsäure-N-alkylamide wie z. B. Salicylsäure-n-octylamid oder Salicylsäure-n-decylamid.

[0037] Als Enzyminhibitoren sind beispielsweise Esteraseinhibitoren geeignet. Hierbei handelt es sich vorzugsweise um Trialkylcitrate wie Trimethylcitrat, Tripropylcitrat, Triisopropylcitrat, Tributylcitrat und insbesondere Triethylcitrat (Hydagen® CAT). Die Stoffe inhibieren die Enzymaktivität und reduzieren dadurch die Geruchsbildung. Weitere Stoffe, die als Esteraseinhibitoren in Betracht kommen, sind Sterolsulfate oder -phosphate, wie beispielsweise Lanosterin-, Cholesterin-, Campesterin-, Stigmasterin- und Sitosterinsulfat bzw. -phosphat, Dicarbonsäuren und deren Ester, wie beispielsweise Glutarsäure, Glutarsäuremonoethylester, Glutarsäurediethylester, Adipinsäure, Adipinsäuremonoethylester, Adipinsäurediethylester, Malonsäure und Malonsäurediethylester, Hydroxycarbonsäuren und deren Ester wie beispielsweise Citronensäure, Äpfelsäure, Weinsäure oder Weinsäurediethylester, sowie Zinkglycinat.

[0038] Als Geruchsabsorber eignen sich Stoffe, die geruchsbildende Verbindungen aufnehmen und weitgehend festhalten können. Sie senken den Partialdruck der einzelnen Komponenten und verringern so auch ihre Ausbreitungsgeschwindigkeit. Wichtig ist, daß dabei Parfums unbeeinträchtigt bleiben müssen. Geruchsabsorber haben keine Wirksamkeit gegen Bakterien. Sie enthalten beispielsweise als Hauptbestandteil ein komplexes Zinksalz der Ricinolsäure oder spezielle, weitgehend geruchsneutrale Duftstoffe, die dem Fachmann als "Fixateure" bekannt sind, wie z. B. Extrakte von Labdanum bzw. Styrax oder bestimmte Abietinsäurederivate. Als Geruchsüberdecker fungieren Riechstoffe oder Parfümöle, die zusätzlich zu ihrer Funktion als Geruchsüberdecker den Deodorantien ihre jeweilige Duftnote verleihen. Als Parfümöle seien beispielsweise genannt Gemische aus natürlichen und synthetischen Riechstoffen. Natürliche Riechstoffe sind Extrakte von Blüten, Stengeln und Blättern, Früchten, Fruchtschalen, Wurzeln, Hölzern, Kräutern und Gräsern, Nadeln und Zweigen sowie Harzen und Balsamen. Weiterhin kommen tierische Rohstoffe in Frage, wie beispielsweise Zibet und Castoreum. Typische synthetische Riechstoffverbindungen sind Produkte vom Typ der Ester, Ether, Aldehyde, Ketone, Alkohole und Kohlenwasserstoffe. Riechstoffverbindungen vom Typ der Ester sind z.B. Benzylacetat, p-tert.-Butylcyclohexylacetat, Linalylacetat, Phenylethylacetat, Linalylbenzoat, Benzylformiat, Allylcyclohexylpropionat, Styrallylpropionat und Benzylsalicylat. Zu den Ethern zählen beispielsweise Benzylethylether, zu den Aldehyden z.B. die linearen Alkanale mit 8 bis 18 Kohlenstoffatomen, Citral, Citronellal, Citronellyloxyacetaldehyd, Cyclamenaldehyd, Hydroxycitronellal, Lilial und Bourgeonal, zu den Ketonen z.B. die Jonone und Methylcedrylketon, zu den Alkoholen Anethol, Citronellol, Eugenol, Isoeugenol, Geraniol, Linalool, Phenylethylalkohol und Terpineol, zu den Kohlenwasserstoffen gehören hauptsächlich die Terpene und Balsame. Bevorzugt werden jedoch Mischungen verschiedener Riechstoffe verwendet, die gemeinsam eine ansprechende Duftnote erzeugen. Auch ätherische Öle geringerer Flüchtigkeit, die meist als Aromakomponenten verwendet werden, eignen sich als Parfümöle, z.

B. Salbeiöl, Kamillenöl, Nelkenöl, Melissenöl, Minzenöl, Zimtblätteröl, Lindenblütenöl, Wacholderbeerenöl, Vetiveröl, Olibanöl, Galbanumöl, Labdanumöl und Lavandinöl. Vorzugsweise werden Bergamotteöl, Dihydromyrcenol, Lilial, Lyral, Citronellol, Phenylethylalkohol, α -Hexylzimtaldehyd, Geraniol, Benzylacetone, Cyclamenaldehyd, Linalool, Boisambrene Forte, Ambroxan, Indol, Hedione, Sandelice, Citronenöl, Mandarinenöl, Orangenöl, Allylmylglycolat, Cyclovertal, Lavandinöl, Muskateller Salbeiöl, β -Damascone, Geraniumöl Bourbon, Cyclohexylsalicylat, Vertofix Coeur, Iso-E-Super, Fixolide NP, Evernyl, Iraldein gamma, Phenyllessigsäure, Geranylacetat, Benzylacetat, Rosenoxid, Romilat, Irotyl und Floramat allein oder in Mischungen, eingesetzt.

[0039] Antitranspirantien (Antiperspirantien) reduzieren durch Beeinflussung der Aktivität der ekkrinen Schweißdrüsen die Schweißbildung, und wirken somit Achselnässe und Körpergeruch entgegen. Wässrige oder wasserfreie Formulierungen von Antitranspirantien enthalten typischerweise folgende Inhaltsstoffe:

- > adstringierende Wirkstoffe,
- > Ölkomponenten,
- > nichtionische Emulgatoren,
- > Coemulgatoren,
- > Konsistenzgeber,
- > Hilfsstoffe wie z. B. Verdicker oder Komplexierungsmittel und/oder
- > nichtwässrige Lösungsmittel wie z. B. Ethanol, Propylenglykol und/oder Glycerin.

[0040] Als adstringierende Antitranspirant-Wirkstoffe eignen sich vor allem Salze des Aluminiums, Zirkoniums oder des Zinks. Solche geeigneten antihydrotisch wirksamen Wirkstoffe sind z.B. Aluminiumchlorid, Aluminiumchlorhydrat, Aluminiumdichlorhydrat, Aluminiumsesquichlorhydrat und deren Komplexverbindungen z. B. mit Propylenglykol-1,2. Aluminiumhydroxyallantoinat, Aluminiumchloridtartrat, Aluminium-Zirkonium-Trichlorhydrat, Aluminium-Zirkonium-tetrachlorhydrat, Aluminium-Zirkonium-pentachlorhydrat und deren Komplexverbindungen z. B. mit Aminosäuren wie Glycin. Daneben können in Antitranspirantien übliche öllösliche und wasserlösliche Hilfsmittel in geringeren Mengen enthalten sein. Solche öllöslichen Hilfsmittel können z.B. sein:

- > entzündungshemmende, hautschützende oder wohlriechende ätherische Öle,
- > synthetische hautschützende Wirkstoffe und/oder
- > öllösliche Parfümöle.

[0041] Übliche wasserlösliche Zusätze sind z.B. Konservierungsmittel, wasserlösliche Duftstoffe, pH-Wert-Stellmittel, z.B. Puffergemische, wasserlösliche Verdickungsmittel, z.B. wasserlösliche natürliche oder synthetische Polymere wie z.B. Xanthan-Gum, Hydroxyethylcellulose, Polyvinylpyrrolidon oder hochmolekulare Polyethylenoxide.

Filmbildner

[0042] Gebräuchliche Filmbildner sind beispielsweise Chitosan, mikrokristallines Chitosan, quaterniertes Chitosan, Polyvinylpyrrolidon, Vinylpyrrolidon-Vinylacetat-Copolymerisate, Polymere der Acrylsäurereihe, quaternäre Cellulose-Derivate, Kollagen, Hyaluronsäure bzw. deren Salze und ähnliche Verbindungen.

Antischuppenwirkstoffe

[0043] Als Antischuppenwirkstoffe kommen Pirocton Olamin (1-Hydroxy-4-methyl-6-(2,4,4-trimethylpentyl)-2-(1H)-pyridinonmonoethanolaminsalz), Baypival® (Climbazole), Ketoconazol®, (4-Acetyl-1-{4-[2-(2,4-dichlorphenyl) r-2-(1H-imidazol-1-ylmethyl)-1,3-dioxylan-c-4-ylmethoxyphenyl]piperazin, Ketoconazol, Elubiol, Selendisulfid, Schwefel kolloidal, Schwefelpolyethylenglykolsorbitanmonooleat, Schwefelrizinolpolyethoxyat, Schwefel-teer Destillate, Salicylsäure (bzw. in Kombination mit Hexachlorophen), Undexylensäure Monoethanolamid Sulfosuccinat Na-Salz, Lamepon® UD (Protein-Undecylensäurekondensat), Zinkpyrithion, Aluminiumpyrithion und Magnesiumpyrithion / Dipyrithion-Magnesiumsulfat in Frage.

Quellmittel

[0044] Als Quellmittel für wässrige Phasen können Montmorillonite, Clay Mineralstoffe, Pemulen sowie alkylmodifizierte Carbopoltypen (Goodrich) dienen. Weitere geeignete Polymere bzw. Quellmittel können der Übersicht von R. Lochhead in Cosm.Toil. 108, 95 (1993) entnommen werden.

Insekten-Repellentien

[0045] Als Insekten-Repellentien kommen N,N-Diethyl-m-toluamid, 1,2-Pentandiol oder Ethyl Butylacetylaminopropionate in Frage

Selbstbräuner und Depigmentierungsmittel

[0046] Als Selbstbräuner eignet sich Dihydroxyacetone. Als Tyrosinhibitoren, die die Bildung von Melanin verhindern und Anwendung in Depigmentierungsmitteln finden, kommen beispielsweise Arbutin, Ferulasäure, Kojisäure, Cumarsäure und Ascorbinsäure (Vitamin C) in Frage.

Hydrotrope

[0047] Zur Verbesserung des Fließverhaltens können ferner Hydrotrope, wie beispielsweise Ethanol, Isopropylalkohol, oder Polyole eingesetzt werden. Polyole, die hier in Betracht kommen, besitzen vorzugsweise 2 bis 15 Kohlenstoffatome und mindestens zwei Hydroxylgruppen. Die Polyole können noch weitere funktionelle Gruppen, insbesondere Aminogruppen, enthalten bzw. mit Stickstoff modifiziert sein. Typische Beispiele sind

- Glycerin;
- Alkylenglycole, wie beispielsweise Ethylenglycol, Diethylenglycol, Propylenglycol, Butylenglycol, Hexylenglycol sowie Polyethylenglycole mit einem durchschnittlichen Molekulargewicht von 100 bis 1.000 Dalton;
- technische Oligoglyceringemische mit einem Eigenkondensationsgrad von 1,5 bis 10 wie etwa technische Diglyceringemische mit einem Diglyceringehalt von 40 bis 50 Gew.-%;
- Metholverbindungen, wie insbesondere Trimethylethan, Trimethylpropan, Trimethylbutan, Pentaerythrit und Dipentaerythrit;
- Niedrigalkylglucoside, insbesondere solche mit 1 bis 8 Kohlenstoffatomen im Alkylrest, wie beispielsweise Methyl- und Butylglucosid;
- Zuckeralkohole mit 5 bis 12 Kohlenstoffatomen, wie beispielsweise Sorbit oder Mannit;
- Zucker mit 5 bis 12 Kohlenstoffatomen, wie beispielsweise Glucose oder Saccharose;
- Aminosucker, wie beispielsweise Glucamin;
- Dialkoholamine, wie Diethanolamin oder 2-Amino-1,3-propandiol.

Konservierungsmittel

[0048] Als Konservierungsmittel eignen sich beispielsweise Phenoxyethanol, Formaldehydlösung, Parabene, Pentandiol oder Sorbinsäure sowie die in Anlage 6, Teil A und B der Kosmetikverordnung aufgeführten weiteren Stoffklassen.

Parfümöle

[0049] Als Parfümöle seien genannt Gemische aus natürlichen und synthetischen Riechstoffen. Natürliche Riechstoffe sind Extrakte von Blüten (Lilie, Lavendel, Rosen, Jasmin, Neroli, Ylang-Ylang), Stengeln und Blättern (Geranium, Patchouli, Petitgrain), Früchten (Anis, Koriander, Kümmel, Wacholder), Fruchtschalen (Bergamotte, Zitrone, Orangen), Wurzeln (Macis, Angelica, Sellerie, Kardamon, Costus, Iris, Calmus), Hölzern (Pinien-, Sandel-, Guajak-, Zedern-, Rosenholz), Kräutern und Gräsern (Estragon, Lemongras, Salbei, Thymian), Nadeln und Zweigen (Fichte, Tanne, Kiefer, Latschen), Harzen und Balsamen (Galbanum, Elemi, Benzoe, Myrrhe, Olibanum, Opoponax). Weiterhin kommen tierische Rohstoffe in Frage, wie beispielsweise Zibet und Castoreum. Typische synthetische Riechstoffverbindungen sind Produkte vom Typ der Ester, Ether, Aldehyde, Ketone, Alkohole und Kohlenwasserstoffe. Riechstoffverbindungen vom Typ der Ester sind z.B. Benzylacetat, Phenoxyethylisobutyrat, p-tert.-Butylcyclohexylacetat, Linalylacetat, Dimethylbenzylcarbinylacetat, Phenylethylacetat, Linalylbenzoat, Benzylformiat, Ethylmethylphenylglycinat, Allylcyclohexylpropionat, Styrallylpropionat und Benzylsalicylat. Zu den Ethern zählen beispielsweise Benzylethylether, zu den Aldehyden z.B. die linearen Alkanale mit 8 bis 18 Kohlenstoffatomen, Citral, Citronellal, Citronellyloxyacetaldehyd, Cyclamenaldehyd, Hydroxycitronellal, Lilial und Bourgeonal, zu den Ketonen z.B. die Jonone, α -Isomethylionon und Methylcedrylketon, zu den Alkoholen Anethol, Citronellol, Eugenol, Isoeugenol, Geraniol, Linalool, Phenylethylalkohol und Terpeneol, zu den Kohlenwasserstoffen gehören hauptsächlich die Terpene und Balsame. Bevorzugt werden jedoch Mischungen verschiedener Riechstoffe verwendet, die gemeinsam eine ansprechende Duftnote erzeugen. Auch ätherische Öle geringerer Flüchtigkeit, die meist als Aromakomponenten verwendet werden, eignen sich als Parfümöle, z.B. Salbeiöl, Kamillenöl, Nelkenöl, Melissenöl, Minzenöl, Zimtblätteröl, Lindenblütenöl, Wacholderbeeren-

EP 1 174 118 A1

öl, Vetiveröl, Olibanöl, Galbanumöl, Labolanumöl und Lavandinöl. Vorzugsweise werden Bergamotteöl, Dihydromyrcenol, Lilial, Lyrall, Citronellol, Phenylethylalkohol, α -Hexylzimtaldehyd, Geraniol, Benzylacetone, Cyclamenaldehyd, Linalool, Boisambrene Forte, Ambroxan, Indol, Hedione, Sandelice, Citronenöl, Mandarinenöl, Orangenöl, Allylamylglycolat, Cyclovertal, Lavandinöl, Muskateller Salbeiöl, β -Damascone, Geraniumöl Bourbon, Cyclohexylsalicylat, Vertofix Coeur, Iso-E-Super, Fixolide NP, Evermyl, Iraldein gamma, Phenylelessigsäure, Geranylacetat, Benzylacetat, Rosinoxid, Romillat, Irotyl und Floramat allein oder in Mischungen, eingesetzt.

Farbstoffe

[0050] Als Farbstoffe können die für kosmetische Zwecke geeigneten und zugelassenen Substanzen verwendet werden, wie sie beispielsweise in der Publikation "Kosmetische Färbemittel" der Farbstoffkommission der Deutschen Forschungsgemeinschaft, Verlag Chemie, Weinheim, 1984, S.81-106 zusammengestellt sind. Diese Farbstoffe werden üblicherweise in Konzentrationen von 0,001 bis 0,1 Gew.-%, bezogen auf die gesamte Mischung, eingesetzt.

[0051] Der Gesamtanteil der Hilfs- und Zusatzstoffe kann 1 bis 50, vorzugsweise 5 bis 40 Gew.-% bezogen auf die Mittel- betragen. Die Herstellung der Mittel kann durch übliche Kalt- oder Heißprozesse erfolgen; vorzugsweise arbeitet man nach der Phaseninversionstemperatur-Methode.

Beispiele

[0052] **Wirkstoffe.** Für die nachfolgenden Wirksamkeitstests wurden die Produkte gemäß Tabelle 1 verwendet:

Tabelle 1

Eingesetzte Inuline und Inulinderivate		
Bezeichnung	Zusammensetzung	Polymerisationsgrad P/ Molekulargewicht M
ILW	Inulin LW 1)	P = 7, M = 1.315
IHW	Inulin HW 2)	P = 20,5, M = 3.800
IPO	Inulin HP + 1 Eq PO	M = 4.800
IDEAE	Inulin HP + 1 Eq DEAE-Cl	M = 5.500
IQ188	Inulin HP + 0,4 Eq QUAB 188	M = 4.700
IQ188DEAE	Inulin HP + 1,1 Eq QUAB 188 + 0,5 Eq DEAE	M = 7.500
IPODEAE	Inulin HP + 1 Eq PO + 1 Eq DEAE-Cl	M = 5.800
IPOQ342	Inulin HP + 1 Eq PO + 0,5 Eq QUAB 342	M = 6.800

1) Inulin Frutafit® IQ 2) Inulin Raftiline® HP

[0053] **Wirksamkeit in der Hautverjüngung und bei der Repair-Wirkung.** Zur Untersuchung der Wirksamkeit der Inuline bzw. Inulinderivate bei der Hautverjüngung bzw. im Hinblick auf die Stimulierung der Repair-Wirkung der Hautzellen wurde ihr Einfluß in Mengen von 0,001 bis 3 Gew.-% auf das Wachstum bzw. die Überlebensrate von menschlichen Fibroblasten untersucht. Die Ergebnisse sind in Tabelle 2 zusammengefaßt. Angegeben ist der relative prozentuale Anstieg des ATP- bzw. Proteingehaltes gegen einen Standard ohne Zusatz der Wirkstoffe (= 100 %).

[0054] **Anti-Ageing Wirkung.** Die Wirksamkeit gegen Hautalterung wurde in vitro anhand der Stimulierung der G6PDH (= Glucose-6-phosphat-dehydrogenase) Aktivität nach der Methode von Okada an menschlichen dermalen Fibroblasten untersucht. Der DNA-Gehalt in den Zellen wurde nach dem Verfahren von Desaulniers bestimmt. Die Ergebnisse sind in Tabelle 3 zusammengefaßt. Auch hier ist jeweils der relative Anstieg gegen einen Blindwert als Standard (= 100 %) angegeben.

Tabelle 2

Wachstum und Überlebensrate menschlicher Fibroblasten					
Wirkstoff	Fibroblastenwachstum			Überlebensrate	
	Konz. [%]	ATP [%]	Proteine [%]	Konz. [%]	Proteine [%]
ILW	3	114	133	3	133
IHW	1	123	105	1	110

EP 1 174 118 A1

Tabelle 2 (fortgesetzt)

Wachstum und Überlebensrate menschlicher Fibroblasten					
Wirkstoff	Fibroblastenwachstum			Überlebensrate	
	Konz. [%]	ATP [%]	Proteine [%]	Konz. [%]	Proteine [%]
IPO	3	112	114	3	126
IDEAE	0,01	109	149	0,03	130
IQ188	0,3	116	109	1	119
IQ188DEAE	0,01	101	147	0,03	117
IPODEAE	0,01	118	138	0,03	136
IPOQ342	0,0001	107	100		

Tabelle 3

G6PDH-Aktivität und DNA-Gehalt in menschlichen Fibroblasten					
Wirkstoff	Konz. [%]	G6PDH		DNA	
		nach 3 d	nach 6 d	nach 3 d	nach 6 d
ILW	1	111	132	100	113
IHW	1	105	138	115	126
IPO	0,1			112	114
IDEAE	0,01	149	124	127	113
IQ188	0,1	159	112	104	127
IQ188DEAE	0,001	122			
IPODEAE	0,003	175		109	133

[0055] Stimulation der Immunaktivität in vitro. Die Aktivität von Inulinen bei der Stimulierung der Immunaktivität wurde mittels ihrer Wirkung auf eine Zelllinie menschlicher polymorphonuclearer neutrophiler Granulocyten (PMN) untersucht. Hierzu wurden menschliche Leukocyten mit den Wirkstoffen über 24 h bei 37 °C und einer CO₂-Konzentration von 5 Vol.-% inkubiert. Anschließend wurde der Zellsuspension zur Auslösung eines Atmungsausbruchs ein Hefeextrakt vom Typ Zymosan zugesetzt und das System weitere 30 min unter den gleichen Bedingungen inkubiert. Die Quantifizierung der reaktiven Sauerstoffspezies ("reactive oxygen species" = ROS) erfolgte mit Hilfe von Luminol, zur Auszählung der PMN wurde ein automatischer Zellzähler verwendet. Die Ergebnisse sind in Tabelle 4 zusammengefaßt. Auch hier erfolgte die Angabe wiederum gegen einen Blindwert als Vergleichsstandard (= 100 %).

Tabelle 4

Reactive oxygen species und Zellzahlen			
Wirkstoff	Konz. [%]	ROS [%]	Zellzahlen [%]
ILW	0,1	135	111
IHW	0,1	147	101
IPO	0,1	196	107
IDEAE	0,1	216	118
IQ188	0,1	184	115
IQ188DEAE	0,1	614	112
IPODEAE	0,1	194	121

[0056] Anti-inflammatorische Wirkung. UV-B-Strahlung aktiviert das Enzym Phospholipase A2, welches aus der

Zellmembran der Keratinocyten Arachidonsäure freisetzt. Cytooxxygenasen wandeln die Arachidonsäure in Prostaglandine um, die von der Zelle sekretiert werden. Die Prostaglandine (PGE₂) lagern sich an spezielle Rezeptoren in der Haut und bewirken auf diese Weise Rötungen und Schwellungen. Mit der UV-B-Schädigung geht die Freisetzung von Lactat Dehydrogenase (LDH) sowie DNA-Fragmenten einher, welche zur Detektierung der Schädigung herangezogen werden können. Hierzu wurden menschliche Keratinocyten mit den Wirkstoffen über 24 h bei 37 °C und 5 Vol.-% CO₂ inkubiert und während dieser Zeit mit UV-B-Strahlung (50 mJ/cm²) geschädigt. Anschließend wurde die Zellzahl durch einen automatischen Zellzähler sowie der Gehalt an cytoplasmischen DNA nach der ELISA-Methode bestimmt. Die Messung der Menge an freigesetzter LDH und PGE₂ erfolgte enzymatisch bzw. ebenfalls nach der ELISA-Methode. Die Ergebnisse sind in Tabelle 5 zusammengefaßt. Die Angaben beziehen sich wieder auf einen Blindwert als Standard (= 0 bzw. 100 %).

Tabelle 5

Anti-inflammatorische Wirkung				
Wirkstoff	Zellzahl [%]	LDH [%]	PGE ₂ [%]	DNA[%]
ohne	100	0	0	0
ohne + UV-B	20	100	100	100
ILW		90	91	73
IHW	21	80	78	
IPO	21	82	84	0
IDEAE	65	32	14	0
IQ188	40	57	21	0
IQ188DEAE	58	34	23	0
IPODEAE	40	49	51	0

[0057] Inhibierung der Glycation von Kollagen. Zum Nachweis, dass die Inuline die nichtenzymatische Glycation von Makromolekülen inhibieren, wurde Kollagen des Typs I mit Glucose und den Wirkstoffen über einen Zeitraum von 21 d bei 45 °C behandelt. Anschließend wurden die Suspensionen zentrifugiert und der Gehalt an Schiff'schen Basen in der überstehenden Flüssigkeit durch Fluoreszenzmessung bei 430 nm bestimmt. Die Ergebnisse sind in Tabelle 6 zusammengefaßt. Die Angaben beziehen sich wieder auf Blindwerte als Standards.

Tabelle 6

Ausbeute an Schiff'schen Basen		
Wirkstoff	Konzentration [% w/v]	Fluoreszenzausbeute [%]
ohne	0	44
ohne + Glucose	0	100
IPO	0,1	91
IDEAE	0,1	55
IQ188	0,1	54
IQ188DEAE	0,1	53
IPODEAE	0,1	63
IPOQ342	0,1	62

[0058] Elastaseinhibierung. Elastase stellte eine Protease dar, welche entweder während einer Inflammation durch die Leukocyten oder infolge UV-A-Schädigung von den Fibroblasten ausgeschieden wird und für den Abbau von dermalen Makromolekülen, wie z.B. Kollagen und damit für die Hautalterung mitverantwortlich ist. Zur Untersuchung der Wirksamkeit der Inuline die Freisetzung von Elastase zu inhibieren wurde Pankreaselastase auf Elastin mit Kongorot markiert. Das System wurde mit den Wirkstoffen über 30 min bei Raumtemperatur inkubiert und anschließend nach Zentrifugation die optische Dichte des Farbstoffes bei 520 nm bestimmt. Die Ergebnisse sind in Tabelle 7 zusammen-

EP 1 174 118 A1

gefaßt. Die Angabe erfolgte wieder relativ zu einem Standard (= 0 %).

Tabelle 7

Elastaseinhibierung		
Wirkstoff	Konzentration [%]	Inhibierung [%]
IDEAE	0,3	29
IQ188	0,3	14
IQ188DEAE	0,3	91
IPOQ342	0,3	78

[0059] **Hautweißung.** Die Aktivität der Inuline als Hautweißungsmittel wurde über die Inhibierung des für die Melaninbildung entscheidenden Enzyms Tyrosinase bestimmt. Hierzu wurden die Inuline mit Tyrosin, L-DOPA und Pilz-Tyrosinase gemischt, 2 min inkubiert und dann die Kinetik der Melaninbildung nach der Methode von Montastier [18. IFSCC Kongress, Venedig, 1994, S. 595-610] photometrisch über die optische Dichte bei 475 nm bestimmt. Die Ergebnisse sind in Tabelle 8 zusammengefaßt. Angegeben ist die prozentuale Inhibierung gegen einen Standard ohne Zusatz von Inulin.

Tabelle 8

Tyrosinase-Inhibierung		
Wirkstoff	Konzentration [% w/v]	Inhibierung [%]
IDEAE	0,5	21
IQ188	0,5	23
IQ188DEAE	0,5	28
IPODEAE	0,5	20

Patentansprüche

1. Verwendung von Inulinen und/oder Inulinderivaten zur Herstellung von Hautpflegemitteln.
2. Verwendung von Inulinen und/oder Inulinderivaten zur Herstellung von Sonnenschutzmitteln.
3. Verwendung von Inulinen und/oder Inulinderivaten zur Herstellung von Hautweißungsmitteln.
4. Verwendung von Inulinen und/oder Inulinderivaten als anti-inflammatorische Wirkstoffe.
5. Verwendung von Inulinen und/oder Inulinderivaten zur Herstellung einer Zubereitung zur Stimulierung der Erneuerung von Hautzellen und dermalen Makromolekülen.
6. Verwendung von Inulinen und/oder Inulinderivaten zur Herstellung einer Zubereitung zur Stimulation des Metabolismus und der Immunabwehr der menschlichen Haut.
7. Verwendung von Inulinen und/oder Inulinderivaten zur Herstellung einer Zubereitung zur Verminderung der Proteolyse und Glycation von Makromolekülen in der menschlichen Haut.
8. Verwendung von Inulinen und/oder Inulinderivaten zur Herstellung einer Zubereitung zur Wundheilung.
9. Verwendung von Inulinen und/oder Inulinderivaten zur Herstellung eines Medikamentes gegen Akne.
10. Verwendung nach mindestens einem der Ansprüche 1 bis 9, **dadurch gekennzeichnet, dass** man Umsetzungsprodukte von Inulin mit Ethylenoxid und/oder Propylenoxid einsetzt.
11. Verwendung nach mindestens einem der Ansprüche 1 bis 9, **dadurch gekennzeichnet, dass** man Umsetzungs-

EP 1 174 118 A1

produkte von Inulin mit halogenierten Hydroxypropylammonium- oder 2,3-Epoxypropyl-ammoniumsalzen ("QUAB's") einsetzt.

12. Verwendung nach mindestens einem der Ansprüche 1 bis 9, **dadurch gekennzeichnet, dass** man Umsetzungs-
produkte von Inulinen mit halogenierten Trialkylaminen einsetzt.
13. Verwendung nach mindestens einem der Ansprüche 1 bis 9, **dadurch gekennzeichnet, dass** man Umsetzungs-
produkte von Inulinen mit Glycidol einsetzt.
14. Verwendung nach mindestens einem der Ansprüche 1 bis 9, **dadurch gekennzeichnet, dass** man Umsetzungs-
produkte von Inulinen mit Propylenoxid und halogenierten Hydroxypropylammonium- oder 2,3-Epoxypropylam-
moniumsalzen einsetzt.
15. Verwendung nach mindestens einem der Ansprüche 1 bis 9, **dadurch gekennzeichnet, dass** man Umsetzungs-
produkte von Inulinen mit Propylenoxid und halogenierten Trialkylaminen einsetzt.
16. Verwendung nach mindestens einem der Ansprüche 1 bis 9, **dadurch gekennzeichnet, dass** man Umsetzungs-
produkte von Inulinen mit Glycidol bzw. Glycidolderivaten und halogenierten Trialkylaminen einsetzt.
17. Verwendung nach mindestens mindestens einem der Ansprüche 1 bis 16, **dadurch gekennzeichnet, dass** man
die Inuline und/oder Inulinerivate in Mengen von 0,0001 bis 5 Gew.-% - bezogen auf die Endzubereitungen -
einsetzt.



Europäisches
Patentamt

EUROPÄISCHER RECHERCHENBERICHT

Nummer der Anmeldung
EP 00 44 0192

EINSCHLÄGIGE DOKUMENTE			
Kategorie	Kennzeichnung des Dokuments mit Angabe, soweit erforderlich, der maßgeblichen Teile	Betrifft Anspruch	KLASSIFIKATION DER ANMELDUNG (Int.Cl.7)
X	US 5 877 144 A (S. ERHARDT ET AL.) 2. März 1999 (1999-03-02) * Anspruch 1; Beispiel 29 *	1	A61K7/48
X	WO 96 01849 A (TIENSE SUIKERRAFFINADERIJ N.V.) 25. Januar 1996 (1996-01-25) * Ansprüche 1,13; Beispiel 39 *	1	
X	DATABASE CHEMICAL ABSTRACTS 'Online!' STN; abstract 128: 261658, XP002152959 * Zusammenfassung * & JP 10 072312 A (SHISEIDO CO., LTD) 17. März 1998 (1998-03-17)	1	
X	DATABASE CHEMICAL ABSTRACTS 'Online!' STN; abstract: 122: 298 723, XP002152960 * Zusammenfassung * & JP 07 053347 A (MITSUBISHI KAGAKU K.K.) 28. Februar 1995 (1995-02-28)	1	
X	DE 195 03 423 A (BEIERSDORF AG) 8. August 1996 (1996-08-08) * Beispiele 3,4,27 *	1	RECHERCHIERTE SACHGEBIETE (Int.Cl.7) A61K
A	WO 98 14482 A (COOPERATIE COSUN U.A.) 9. April 1998 (1998-04-09) * Beispiel 4 *	1	
A	US 5 502 180 A (M. KUNZ ET AL.) 26. März 1996 (1996-03-26) * Spalte 8, Zeile 37-41; Anspruch 1 *	1	
Der vorliegende Recherchenbericht wurde für alle Patentansprüche erstellt			
Recherchenort	Abschlußdatum der Recherche	Prüfer	
DEN HAAG	15. November 2000	Glikman, J-F	
KATEGORIE DER GENANNTEN DOKUMENTE		T : der Erfindung zugrunde liegende Theorien oder Grundsätze E : älteres Patentdokument, das jedoch erst am oder nach dem Anmeldedatum veröffentlicht worden ist D : In der Anmeldung angeführtes Dokument L : aus anderen Gründen angeführtes Dokument A : technologischer Hintergrund O : mündliche Offenbarung P : Zwischenliteratur	
X : von besonderer Bedeutung allein betrachtet Y : von besonderer Bedeutung in Verbindung mit einer anderen Veröffentlichung derselben Kategorie A : technologischer Hintergrund O : mündliche Offenbarung P : Zwischenliteratur		& : Mitglied der gleichen Patentfamilie, übereinstimmendes Dokument	

EPO FORM 1503 03 82 (PctDoc)



Europäisches
Patentamt

EUROPÄISCHER RECHERCHENBERICHT

Nummer der Anmeldung
EP 00 44 0192

EINSCHLÄGIGE DOKUMENTE			
Kategorie	Kennzeichnung des Dokuments mit Angabe, soweit erforderlich, der maßgeblichen Teile	Betrifft Anspruch	KLASSIFIKATION DER ANMELDUNG (Int.Cl.7)
A	DE 196 17 605 A (COOPERATIE SUIKER UNIE U.A.) 7. November 1996 (1996-11-07) * Seite 4, Zeile 28,29; Anspruch 1 *	1	
			RECHERCHIERTE SACHGEBIETE (Int.Cl.7)
Der vorliegende Recherchenbericht wurde für alle Patentansprüche erstellt			
Recherchenort DEN HAAG		Abschlußdatum der Recherche 15. November 2000	Prüfer Glikman, J-F
<p>KATEGORIE DER GENANNTEN DOKUMENTE</p> <p>X : von besonderer Bedeutung allein betrachtet Y : von besonderer Bedeutung in Verbindung mit einer anderen Veröffentlichung derselben Kategorie A : technologischer Hintergrund O : mündliche Offenbarung P : Zwischenliteratur</p> <p>T : der Erfindung zugrunde liegende Theorien oder Grundsätze E : älteres Patentedokument, das jedoch erst am oder nach dem Anmeldedatum veröffentlicht worden ist D : in der Anmeldung angeführtes Dokument L : aus anderen Gründen angeführtes Dokument & : Mitglied der gleichen Patentfamilie, übereinstimmendes Dokument</p>			

EPO FORM 1503 03 82 [P.O. 0003]

**ANHANG ZUM EUROPÄISCHEN RECHERCHENBERICHT
ÜBER DIE EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG NR.**

EP 00 44 0192

In diesem Anhang sind die Mitglieder der Patentfamilien der im obengenannten europäischen Recherchenbericht angeführten Patentdokumente angegeben.
Die Angaben über die Familienmitglieder entsprechen dem Stand der Datei des Europäischen Patentamts am 15-11-2000.
Diese Angaben dienen nur zur Unterrichtung und erfolgen ohne Gewähr.

15-11-2000

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
US 5877144 A	02-03-1999	DE 19607847 C EP 0792888 A JP 9328501 A	20-11-1997 03-09-1997 22-12-1997
WO 9601849 A	25-01-1996	BE 1008498 A BE 1009708 A AT 184290 T AU 695350 B AU 3073195 A BR 9510202 A CA 2193061 A DE 69512071 D DE 69512071 T DK 769026 T EP 0769026 A ES 2138745 T FI 970044 A JP 10502678 T NO 965339 A SI 769026 T	07-05-1996 01-07-1997 15-09-1999 13-08-1998 09-02-1996 04-11-1997 25-01-1996 14-10-1999 25-05-2000 06-03-2000 23-04-1997 16-01-2000 03-01-1997 10-03-1998 07-03-1997 29-02-2000
JP 10072312 A	17-03-1998	KEINE	
JP 07053347 A	28-02-1995	KEINE	
DE 19503423 A	08-08-1996	WO 9623479 A EP 0806935 A JP 10513165 T	08-08-1996 19-11-1997 15-12-1998
WO 9814482 A	09-04-1998	NL 1004153 C AU 719739 B AU 4402597 A EP 0918800 A	31-03-1998 18-05-2000 24-04-1998 02-06-1999
US 5502180 A	26-03-1996	AT 162805 T DE 59405157 D DK 638589 T EP 0638589 A EP 0792889 A JP 7149802 A	15-02-1998 05-03-1998 21-09-1998 15-02-1995 03-09-1997 13-06-1995
DE 19617605 A	07-11-1996	NL 1000279 C BE 1009597 A GB 2300343 A, B NL 1002978 C NL 1002978 A	05-11-1996 06-05-1997 06-11-1996 05-11-1996 05-11-1996

EPO FORM P0481

Für nähere Einzelheiten zu diesem Anhang : siehe Amtsblatt des Europäischen Patentamts, Nr.12/82